

BEST AVAILABLE COPY



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



(11) Veröffentlichungsnummer: **0 265 848 B1**

(12)

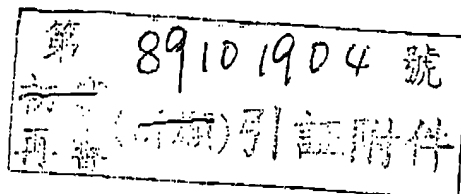
## EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

(45) Veröffentlichungstag der Patentschrift: 25.09.91

(51) Int. Cl.: **A61K 47/00, A61K 31/44**

(21) Anmeldenummer: 87115516.4

(22) Anmeldetag: 22.10.87



(84) Arzneizubereitungen zur oralen Verabreichung, die als Einzeldosis 10 bis 240 mg Dihydropyridin enthalten.

(30) Priorität: 23.10.86 DE 3636123

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
04.05.88 Patentblatt 88/18

(48) Bekanntmachung des Hinweises auf die  
Patenterteilung:  
25.09.91 Patentblatt 91/39

(84) Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE ES FR GB IT LI LU NL SE

(68) Entgegenhaltungen:  
EP-A- 0 068 450  
LU-A- 65 929

H.P. FIEDLER, Lexicon der Hilfsstoffe, Editor  
Cantor Verlag 1981, S. 386-387

(73) Patentinhaber: Dr. Rentschler Arzneimittel  
GmbH & Co.  
Postfach 320 Mittelstrasse 18  
W-7958 Laupheim(DE)

(72) Erfinder: Lahr, Wolfgang  
Sicherweg 29  
W-7958 Laupheim(DE)  
Erfinder: Köhne, Hans, Dr. Dipl.-Chem.  
Rothechwan 7  
W-7958 Obersulmetingen(DE)  
Erfinder: Musculus, Frank  
Gerbe 2  
W-7958 Achstetten(DE)  
Erfinder: Schmersahl, Hain-Uwe, Dr.  
Händelstrasse 36  
W-6479 Limesharn 1(DE)

(74) Vertreter: Schwabe - Sandmair - Marx  
Stuntzstrasse 16  
W-8000 München 80(DE)

EP 0 265 848 B1

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

EP 0 266 848 B1

bis 1 : 10 beträgt.

2. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 1, in der das Verhältnis Dihydropyridin zu den Polyethylenglykolen 1 : 4 bis 1 : 40 beträgt.
3. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 1 oder 2, mit einer Dosis des Dihydropyridins von 30 bis 120 mg.
4. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 1, 2 oder 3, mit einer Dosis des Dihydropyridins von 40 bis 80 mg.
5. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Dihydropyridin Nifedipin enthalten.
6. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, daß Nifedipin in einer Dosis von 30 bis 120 enthalten ist.
7. Feste Arzneizubereitungen nach Anspruch 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Dihydropyridin Nimodipin, Nicardipin, Nitrendipin, Nisoldipin oder Felodipin enthalten.
8. Arzneizubereitungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß sie Lösungsvermittler enthält, wobei das Verhältnis Dihydropyridin zu Lösungsvermittler 1 : 0,01 bis 1 : 3 beträgt.
9. Arzneizubereitungen nach Anspruch 1 bis 8 in Form von Granulaten, Tabletten, Pillen, überzogenen Tabletten, Kapseln, Sachets oder mehrschichtigen Tabletten.
10. Arzneizubereitungen nach Anspruch 1 bis 8 zur Behandlung von koronaren Herzkrankheiten und/oder des Bluthochdrucks.

#### Claims

1. Solid medicament preparations for oral administration, which contain dihydropyridine(s) as active compound(s) in a dose of 10 to 240 mg in dissolved, molecularly disperse state in polyethylene glycols of average molecular weight 6,000 to 35,000 together with a fatty alcohol or fatty alcohol mixture having chain lengths from 6 to 30 carbon atoms, where the ratio of dihydropyridine to the polyethylene glycols is 1:2 to 1:50 and the ratio of dihydropyridine to fatty alcohols is 1:0.1 to 1:10.
2. Solid medicament preparations according to Claim 1, in which the ratio of dihydropyridine to the polyethylene glycols is 1:4 to 1:40.
3. Solid medicament preparations according to Claim 1 or 2, containing a dose of the dihydropyridine of 30 to 120 mg.
4. Solid medicament preparations according to Claim 1, 2 or 3, containing a dose of the dihydropyridine of 40 to 80 mg.
5. Solid medicament preparations according to Claim 1 to 4, characterised in that they contain nifedipine as the dihydropyridine.
6. Solid medicament preparations according to Claim 5, characterised in that nifedipine is present in a dose of 30 to 120 mg.
7. Solid medicament preparations according to Claim 1 to 4, characterised in that they contain nimodipine, nicardipine, nitrendipine, nisoldipine or felodipine as the dihydropyridine.
8. Medicament preparations according to one of the preceding claims, characterised in that they contain solubilizers, the ratio of dihydropyridine to solubilizer being 1:0.01 to 1:3.

BEST AVAILABLE COPY

EP 0 265 848 B1

9. Medicament preparations according to Claim 1 to 8 in the form of granules, tablets, pills, coated tablets, capsules, sachets or multi-coated tablets.
10. Medicament preparations according to Claim 1 to 9 for the treatment of coronary heart diseases and/or of high blood pressure.

## Revendications

1. Préparations pharmaceutiques solides pour administration orale, qui contiennent de la (des) dihydropyridine(s) comme substance(s) active(s) dans une dose de 10 à 240 mg à l'état dissous, en dispersion moléculaire, dans des polyéthylèneglycols de poids moléculaire moyen de 6.000 à 35.000 et un alcool gras ou un mélange d'alcool gras avec des longueurs de chaîne de 8 à 30 atomes C, le rapport dihydropyridine/polyéthylèneglycol étant de 1:2 à 1:50 et le rapport dihydropyridine/alcool gras de 1:0,1 à 1:10.
2. Préparations pharmaceutiques solides selon la revendication 1 caractérisées en ce que le rapport dihydropyridine/polyéthylèneglycols est de 1:4 à 1:40.
3. Préparations pharmaceutiques solides selon la revendication 1 ou 2, avec une dose de dihydropyridine de 30 à 120 mg.
4. Préparations pharmaceutiques solides selon les revendications 1, 2 ou 3 avec une dose de dihydropyridine de 40 à 80 mg.
5. Préparations pharmaceutiques solides selon une des revendications 1 à 4 caractérisées en ce qu'elles contiennent de la nifédipine comme dihydropyridine.
6. Préparations pharmaceutiques solides selon la revendication 5 caractérisées en ce que la nifédipine est contenue dans une dose de 30 à 120 mg.
7. Préparations pharmaceutiques solides selon une des revendications 1 à 4 caractérisées en ce qu'elles contiennent comme dihydropyridine de la nimodipine, de la nifédipine, de la nitrendipine, de la nisoldipine ou de la féléodipine.
8. Préparations pharmaceutiques selon une des revendications précédentes caractérisées en ce qu'elles contiennent des agents solubilisants, le rapport dihydropyridine/agent solubilisant étant de 1:0,01 à 1:3.
9. Préparations pharmaceutiques selon une des revendications 1 à 8 sous forme de granulés, comprimés, pilules, comprimés dragéifiés, capsules, sachets ou comprimés multicouches.
10. Préparations pharmaceutiques selon une des revendications 1 à 9 pour le traitement des maladies coronariennes et/ou de l'hypertension artérielle.